

C07D-403/04; C07D-403/12; C07D-405/02; C07D-405/04; C07D-405/12;  
C07D-409/02; C07D-409/04; C07D-409/12; C07D-521/00

5/7/2

DIALOG(R) File 351:DERWENT WPI  
(c)1997 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

004809423

WPI Accession No: 86-312764/198648

New and known thietyl urea or isourea derivs. - used as animal growth promoters

Patent Assignee: BAYER AG (FARB )

Inventor: BERSCHAUER F; DEJONG A; HALLENBACH W; LINDEL H; SCHEER M

Number of Countries: 019 Number of Patents: 013

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Main IPC	Week
DE 3529247	A	19861120	DE 3529247	A	19850816		198648 B
EP 202538	A	19861126	EP 86106209	A	19860506		198648
AU 8657217	A	19861120					198702
JP 61268678	A	19861128	JP 86109713	A	19860515		198702
DK 8602300	A	19861118					198707
BR 8602224	A	19870113					198708
ZA 8603645	A	19861110	ZA 863645	A	19860520		198708
FI 8602201	A	19861118					198711
HU 41244	T	19870428					198721
CS 8603569	A	19880115					198810
ES 8801815	A	19880501	ES 555052	A	19860516		198824
EP 202538	B	19881228					198901
DE 3661493	G	19890202					198906

Priority Applications (No Kind Date): DE 3517706 A 19850517; DE 3529247 A 19850816

Cited Patents: 1. journal ref.; AT 311994; BR 7802533; DE 2510936; DE 2645613; DE 2648248; US 3989505

Patent Details:

Patent Kind Lan Pg Filing Notes Application Patent

DE 3529247 A 79

EP 202538 A G

Designated States (Regional): AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

EP 202538 B G

Designated States (Regional): AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

Abstract (Basic): DE 3529247 A

(A) Thietyl (iso)ureas of formula (Ia) are new n = 3-6; A = N(R4)CONR5R6 or N(R4)C(OR5)=NR6; R'3 = (a) CN, COOR7, CONR8R9 or COR10 when n = 3, 5 or 6, or (b) COOMe, (2-4C alkenyloxy)carbonyl, CONR8R9 or COR10 when n = 4; R4 = H or alkyl; R5 and R6 = H, opt. subst. alkyl, cycloalkyl, alkenyl, opt. subst. aryl or heteroaryl; R7 = H, opt. subst. alkyl, cycloalkyl, alkenyl or opt. subst. aryl; R8 = H, alkyl or cycloalkyl; R9 = H, opt. subst. alkyl or opt. subst. aryl; R10 = opt. subst. alkyl or opt. subst. aryl.

(B) Thietyl isocyanates of formula (II) are also new, except for 3-methoxycarbonyl -2-thietyl isocyanate; R1 and R2 = H, halogen, NO2, CN, alkoxy, alkylthio, haloalkoxy, haloalkylthio, alkoxyalkyl or opt. subst. alkyl, acyl, aroyl, or aryl, or R1+R2 forms an opt. subst. satd. or unsatd. carbocyclic ring opt. with a carbonyl function; R'3 = COOR'7, CONR8R9 or COR10; R'7 = H, opt. subst. methyl, cycloalkyl, 2-4C alkenyl or opt. subst. aryl.

USE - Use of thietyl (iso)ureas of formula (I) is 'animal productivity promoters' (specifically growth promoters) is claimed. R3 = CN, COOR7, CONR8R9 or COR10. (79pp Dwg.No.0/0)

Abstract (Equivalent): EP 202538 B

Use of thietylureas or -isoureas of the formula (I) in which A represents the radicals (Ia) and (Ib) R1 represents hydrogen, halogen, nitro, CN, alkoxy, alkylthio, halogenalkoxy, halogenalkylthio, alkoxyalkyl or optionally substituted radicals from the group comprising alkyl, acyl, aroyl, and aryl, R2 represents hydrogen, halogen, nitro, CN, alkoxy,

alkylthio, halogenoalkoxy, halogenalkylthio, alkoxyalkyl or optionally substituted radicals from the group comprising acyl, aroyl, alkyl and aryl, or R1 and R2, together with the adjacent C atoms, represent an optionally substituted saturated or unsaturated carbocyclic or heterocyclic ring, which can optionally carry a carbonyl function, R3 represents the radicals CN, COOR7, COONR8R9 or COR10, R4 represents hydrogen or alkyl, R5 represents, optionally substituted alkyl, cycloalkyl, alkenyl, optionally substituted aryl or heteroaryl, R6 represents hydrogen, optionally substituted alkyl, cycloalkyl, alkenyl, optionally substituted alkyl, cycloalkyl, alkenyl, or optionally substituted aryl, R8 represents hydrogen, alkyl or cycloalkyl, R9 represents hydrogen, optionally substituted alkyl or optionally substituted aryl and R10 represents optionally substituted alkyl or optionally substituted aryl, as growth-promoting agents for animals. (33pp)

Derwent Class: B03; C02

International Patent Class (Additional): A23K-001/16; A61K-031/38; C07D-333/36

5/7/3

DIALOG(R) File 351:DERWENT WPI

(c)1997 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

004068583

WPI Accession No: 84-214124/198435

Herbicultural 4-ureido-thiophene-3 carboxylic acid ester(s) - prep'd. e.g. by reaction of 4-amino-thiophene-3- carboxylic acid ester(s) with isocyanate(s)

Patent Assignee: BASF AG (BADI )

Inventor: ACKER R D; ROSSY P A; WUERZER B

Number of Countries: 004 Number of Patents: 002

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Main IPC	Week
DE 3305866	A	19840823	DE 3305866	A	19830219		198435 B
EP 116932	A	19840829	EP 84101466	A	19840213		198435

Priority Applications (No Kind Date): DE 3305866 A 19830219

Cited Patents: DE 2040579; DE 2122636; EP 90309; US 2453564; US 3931204

Patent Details:

Patent	Kind	Ln	Pg	Filing Notes	Application	Patent
DE 3305866	A		27			
EP 116932	A		G			

Designated States (Regional): DE FR GB IT

Abstract (Basic): DE 3305866 A

Cpds. of formula (I) are new. In (I) R1=H, 1-10C alkyl, 2-10C alkenyl, 2-10C alkynyl, 1-10C haloalkyl, 2-10C alkoxyalkyl, 2-10C alkylthioalkyl, 3-7C cycloalkyl, phenyl(opt. substd) by or benzyl (opt. substd.); R2=1-10C alkyl, 2-10C alkenyl, 2-10C alkynyl, 8-10C phenylalkyl, 1-10C haloalkyl, 2-10C alkoxyalkyl, 2-10C alkylthioalkyl, 3-7C cycloalkyl, phenyl (opt. substd.) or benzyl (opt. substd.).

USE - As selective herbicides in a wide range of crop plants. Application may be pre- or post-emergence and is generally at a rate of 0.1-5 kg/ha or more, pref. 0.5-3 kg/ha.

0/0

Derwent Class: C02

International Patent Class (Additional): A01N-047/36; C07D-333/38

5/7/4

DIALOG(R) File 351:DERWENT WPI

(c)1997 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

002553909

WPI Accession No: 80-71933C EP 16371 EP A 19801001 198041

1-(1-Methyl-4-oxo-2-imidazolinyl)-3-thienyl-urea derivs. - useful as anxiolytics of low toxicity without muscle relaxing and sedating effects

Patent Assignee: HOFFMANN-LA ROCHE AG (HOFF )



⑫

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

⑬ Anmeldenummer: 86106209.9

⑪ Int. Cl. 4: A 23 K 1/16

⑭ Anmeldetag: 06.05.86

C 07 D 333/38, C 07 D 333/68  
C 07 D 333/78, C 07 D 333/80

⑬ Priorität: 17.05.85 DE 3517706  
16.08.85 DE 3529247

⑫ Erfinder: Hallenbach, Werner, Dr.  
Klebststrasse 10  
D-4018 Langenfeld(DE)

⑬ Veröffentlichungstag der Anmeldung:  
26.11.86 Patentblatt 86/48

⑫ Erfinder: Lindel, Hans, Dr.  
Carl-Duisberg-Strasse 321  
D-5090 Leverkusen(DE)

⑬ Benannte Vertragsstaaten:  
AT BE CH DE FR GB IT LI NL SE

⑫ Erfinder: Berschauer, Friedrich, Dr.  
Claudiusweg 9  
D-5600 Wuppertal 1(DE)

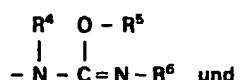
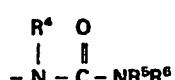
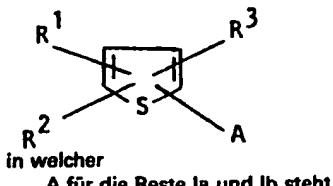
⑬ Anmelder: BAYER AG  
Konzernverwaltung RP Patentabteilung  
D-5090 Leverkusen 1 Bayerwerk(DE)

⑫ Erfinder: Scheer, Martin, Dr.  
Herberts-Katerberg 7  
D-5600 Wuppertal 1(DE)

⑬ Anmelder: de Jong, Anno, Dr.  
Stockmannsmühle 46  
D-5600 Wuppertal 1(DE)

⑭ Leistungsfördernde Mittel.

⑮ Die vorliegende Erfindung betrifft leistungsfördernde  
Mittel für Tiere, die durch einen Gehalt an Thienylharnstoffen  
oder -isoharnstoffen der Formel I



R<sup>3</sup> für die Reste CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht, gekenn-  
zeichnet sind.

06.06.2009

0202538

- 1 -

5 BAYER AKTIENGESELLSCHAFT 5090 Leverkusen, Bayerwerk  
Konzernverwaltung RP  
Patentabteilung Rt/cm/c  
II

10

Leistungsfördernde Mittel

15

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von teilweise bekannten Thienylharnstoffen und -isoharnstoffen als leistungsfördernde Mittel bei Tieren.

20

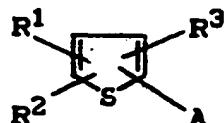
Thienylharnstoffe sind bereits bekannt geworden. Sie finden Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren (vgl. DE-OS 2 040 579, 2 122 636, 2 627 935, 3 305 866, EP-OS 4 931).

25

Es ist jedoch nichts über ihren Einsatz als leistungsfördernde Mittel bei Tieren bekannt geworden.

1. Es wurde gefunden, daß Thienylharnstoffe und -isoharnstoffe der Formel I

30



35

in welcher

Le A 23 725-Ausland

5      A      für die Reste Ia und Ib steht



10



15      R<sup>1</sup>      für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Alkyl, Acyl, Aroyl, Aryl steht,

20      R<sup>2</sup>      für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Acyl, Aroyl, Alkyl, Aryl steht,

25      R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit den angrenzenden C-Atomen für einen gegebenenfalls substituierten gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen oder heterocyclischen Ring stehen, der gegebenenfalls eine Carbonylfunktion tragen kann,

30      R<sup>3</sup>      für die Reste CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

R<sup>4</sup>      für Wasserstoff oder Alkyl steht,

35

5      R<sup>5</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

10     R<sup>6</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

15     R<sup>7</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl steht,

20     R<sup>8</sup>    für Wasserstoff oder Alkyl oder Cycloalkyl  
steht,

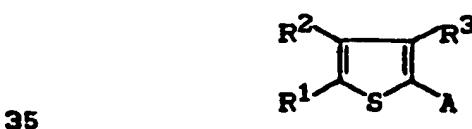
25     R<sup>9</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl  
steht,

30     R<sup>10</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

hervorragende leistungsfördernde Wirkung bei Tieren  
besitzen. Thienylharnstoffe und -isocharnstoffe der  
Formel I sind z.T. bekannt.

30

Thienylharnstoffe der Formel II



Le A 23 725

## 5 in welcher

A für den Rest ist steht



15 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Acyl, Aroyl, Aryl steht,

20 R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Acyl, Aroyl, Alkyl, Aryl steht.

25  $R^1$  und  $R^2$  gemeinsam mit den angrenzenden C-Atomen für einen gegebenenfalls substituierten gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring stehen, der gegebenenfalls eine Carbonylfunktion tragen kann.

30  $R^3$  für die Reste  $CN$ ,  $COOR^7$ ,  $CONR^8R^9$ ,  $COR^{10}$  steht,

$R^4$  für Wasserstoff oder Alkyl steht.

35

5      R<sup>5</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

10     R<sup>6</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

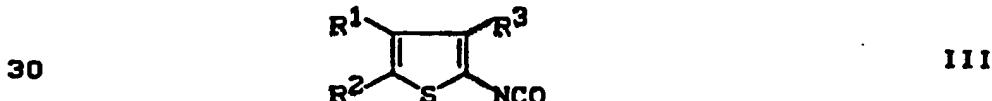
15     R<sup>7</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

20     R<sup>8</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

25     R<sup>9</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

R<sup>10</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

Können z.B. hergestellt werden, indem man Thienyl-isocyanate der Formel III



in welcher

35     R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

5 mit Aminen der Formel IV



10 in welcher

15  $\text{R}^5$  und  $\text{R}^6$  die oben angegebene Bedeutung haben,  
umsetzt.

20 2. Es wurden die neuen Thienylisocyanate der Formel III  
gefunden.



III

in welcher

25  $\text{R}^1$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy,  
Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio,  
Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste  
aus der Gruppe Alkyl, Acyl, Aroyl, Aryl steht,

30  $\text{R}^2$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy,  
Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio,  
Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste  
aus der Gruppe Alkyl, Acyl, Aroyl, Aryl  
steht,

35

5       $R^1$  und  $R^2$  gem insam mit d n angrenz nden C-Atomen für  
einen gegebenenfalls substituierten gesättigten  
oder ungesättigten carbocyclischen Ring stehen,  
der gegebenenfalls eine Carbonylfunktion tragen  
kann,

10

$R^3$  für die Reste  $COOR^7$ ,  $CONR^8R^9$ ,  $COR^{10}$  steht,

15

$R^7$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Methyl, Cycloalkyl,  $C_{2-4}$ -Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl steht,

$R^8$  für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

20

$R^9$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl  
steht,

25

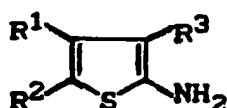
$R^{10}$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

mit Ausnahme von 3-Methoxycarbonyl-thien-2-yl-isocyanat.

30

3. Es wurde ferner gefunden, daß man die neuen Thienyl-isocyanate der Formel III gemäß 2 (oben) herstellen kann, indem man Thienylamine der Formel V

35



V

5

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  die in 2 (oben) angegebene Bedeutung haben,

10

mit Phosgen umsetzt.

4. Es wurden ferner die neuen Thienylharnstoffe und -isocharnstoffe der Formel VI gefunden

15



VI

in welcher

20

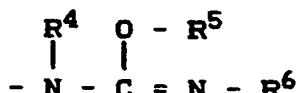
n für 3, 4, 5 oder 6 steht,

A für die Reste Ia und Ib steht

25



Ia



Ib

30

$R^3$  für den Fall, daß n für 3, 5, 6 steht, für die Reste CN,  $COOR^7$ ,  $CONR^8R^9$ ,  $COR^{10}$  steht und für den Fall, daß n für 4 steht, für die Reste  $COOCH_3$ ,  $COO(C_{2-4}-\text{Alkenyl})$ ,  $CONR^8R^9$ ,  $COR^{10}$  steht,

35

5        R<sup>4</sup>    für Wasserstoff oder Alkyl steht,

10      R<sup>5</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

15      R<sup>6</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

20      R<sup>7</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

25      R<sup>8</sup>    für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

30      R<sup>9</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

35      R<sup>10</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht.

5. Es wurde ferner gefunden, daß man die Thienylharnstoffe oder -isocharnstoffe der Formel VI erhält,



VI

35

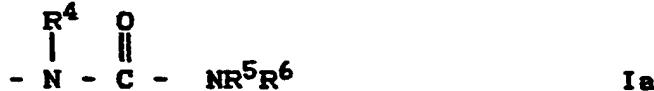
Le A 23 725

5 in welch r

n für 3, 4, 5 oder 6 steht,

A für die Reste Ia und Ib steht

10



15



20

$\text{R}^3$  für den Fall, daß n für 3,5,6 steht, für die Reste  $\text{CN}$ ,  $\text{COOR}^7$ ,  $\text{CONR}^8\text{R}^9$ ,  $\text{COR}^{10}$  steht und für den Fall, daß n für 4 steht, für die Reste  $\text{COOCH}_3$ ,  $\text{COO}(\text{C}_{2-4}\text{-Alkenyl})$ ,  $\text{CONR}^8\text{R}^9$ ,  $\text{COR}^{10}$  steht,

 $\text{R}^4$  für Wasserstoff oder Alkyl steht,

25

$\text{R}^5$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

30

$\text{R}^6$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

35

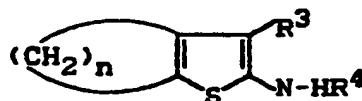
$\text{R}^7$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

 $\text{R}^8$  für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

5       $R^9$  für Wasserstoff,  $g$  gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

10      $R^{10}$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

15     a) wenn man für den Fall, daß  $A$  für den Rest Ia steht und  $R^5$  für Wasserstoff steht, Thienylamine der Formel VII



VII

20     in welcher

25      $n$ ,  $R^3$  und  $R^4$  die oben angegebene Bedeutung haben

25     mit Isocyanaten der Formel VIII



VIII

30     in welcher

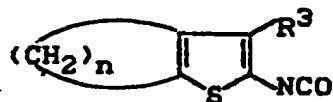
30      $R^6$  die oben angegebene Bedeutung hat,

umsetzt, oder

35

5        b) wenn man für den Fall, daß A für den Rest Ia steht und R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht, Thienyl-isocyanate der Formel IX

10



IX

in welcher

15

n und R<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Aminen der Formel IV



IV

20

in welcher

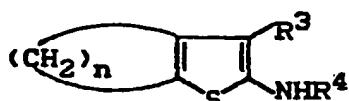
R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

25

umgesetzt, oder

c) wenn man für den Fall, daß A für den Rest Ib steht, Thienylamine der Formel VII

30



VII

in welcher

35

Le A 23 725

5         $n$ ,  $R^3$  und  $R^4$  die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Imidokohlensäureesterhalogeniden der Formel X



in welcher

15         $R^5$  und  $R^6$  die oben angegebene Bedeutung haben und

Hal für Halogen steht,

20        umgesetzt.

Es war völlig überraschend, daß die Thienylharnstoffe der Formel I leistungsfördernde Eigenschaften bei Tieren aufweisen. Es gab aus dem Stand der Technik keinerlei Hinweis 25 auf diese neue Verwendung der teilweise bekannten Thienylharnstoffe der Formel I.

Bevorzugt sind Thienylharnstoffe der Formel I in welcher 30 A für die Reste Ia oder Ib steht,

35         $R^1$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN,  $C_{1-4}$ -Alkoxy,  $C_{1-4}$ -Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes  $C_{1-6}$ -Acyl, gegebenenfalls substituiertes Aroyl, insbe-

5           sondere Benzoyl, für gegebenenfalls durch Halogen,  
 C<sub>1-4</sub>-Alkoxy, C<sub>1-4</sub>-Alkylthio, Aryl, insbesondere  
 Phenyl, Aryloxy, insbesondere Phenoxy, Arylthio,  
 insbesondere Phenylthio, Amino, C<sub>1-4</sub>-Alkylamino,  
 10          Di-C<sub>1-4</sub>-alkylamino, Arylamino, insbesondere Phenyl-  
 amino substituiertes C<sub>1-6</sub>-Alkyl sowie für Phenyl  
 steht, wobei die Phenylreste gegebenenfalls einen  
 oder mehrere der folgenden Substituenten tragen:  
 Halogen, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, CN, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy, C<sub>1-4</sub>-Alkylthio,  
 Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Amino, C<sub>1-4</sub>-Alkyl-  
 15          amino, Di-C<sub>1-4</sub>- alkylamino, C<sub>1-4</sub>-Alkoxyalkyl,  
 C<sub>1-4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1-4</sub>-Ha-  
 logenalkylthio, Methylendioxy oder Ethylendioxy, die  
 gegebenenfalls halogensubstituiert sind, Acyl.

20 R<sup>2</sup>       für die bei R<sup>1</sup> aufgeführten Reste steht,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit den angrenzenden beiden C-Atomen  
 für gesättigte oder ungesättigte carbocyclische Reste  
 mit 5-8 Ringgliedern stehen, die gegebenenfalls durch  
 25          OH, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, Halogen, Nitro, CN, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy,  
 C<sub>1-4</sub>-Alkylthio, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Amino,  
 C<sub>1-4</sub>-Alkylamino, C<sub>1-4</sub>-Dialkylamino, C<sub>1-4</sub>-Halogenal-  
 kyl, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkylthio,  
 30          C<sub>1-4</sub>-Alkoxyalkyl substituiert sind und einer der  
 Ringglieder, die nicht an den Thiophenring gebunden  
 sind, eine Carbonylfunktion (C = O) tragen kann; für  
 den Fall, daß R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> mit den angrenzenden C-Atomen  
 einen heterocyclischen Ring bilden, hat dieser 5 -  
 35          6 Ringglieder und trägt O, S oder N als Heteroatome.

<sup>5</sup> R<sup>3</sup> für die Rest CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1-4</sub>-Alkyl steht,

<sup>10</sup> R<sup>5</sup> für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy, C<sub>1-4</sub>-Alkylthio, Aryl, insbesondere Phenyl, Aryloxy, insbesondere Phenoxy, Arylthio, insbesondere Phenylthio, Amino, C<sub>1-4</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1-4</sub>-alkylamino substituiertes C<sub>1-6</sub>-Alkyl, C<sub>3-8</sub>-Cycloalkyl, C<sub>2-6</sub>-Alkenyl ferner für Phenyl oder Naphthyl steht, wobei die Phenylreste gegebenenfalls einen oder mehrere der folgenden Substituenten tragen: Halogen, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, CN, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy, C<sub>1-4</sub>-Alkylthio, Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Amino, C<sub>1-4</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1-4</sub>-alkylamino, C<sub>1-4</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkylthio, Methylendioxy oder Ethylenedioxy, die gegebenenfalls halogensubstituiert sind, sowie für Thienyl steht, das gegebenenfalls ein- oder mehrfach durch C<sub>1-4</sub>-Alkyl, CN, Halogen, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy carbonyl substituiert ist,

R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> und R<sup>9</sup> für die bei R<sup>5</sup> angeführten Reste stehen,

<sup>30</sup> R<sup>8</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1-4</sub>-Alkyl, C<sub>3-8</sub>-Cycloalkyl steht,

<sup>35</sup> R<sup>10</sup> für die bei R<sup>5</sup> angeführten Reste, mit Ausnahme von Wasserstoff steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I, in welcher

5 A für die Reste Ia und Ib steht.

10 R<sup>1</sup> für Wasserstoff, C<sub>1-6</sub>-Alkyl, das gegebenenfalls durch Fluor, Chlor oder Brom substituiert ist, Phenyl, das gegebenenfalls durch C<sub>1-4</sub>-Alkyl, Halogen, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkyl, insbesondere Trifluormethyl, C<sub>1-4</sub>-Hogenalkoxy, insbesondere Trifluormethoxy substituiert ist, für Nitro, Acyl, insbesondere Acetyl, steht.

15 R<sup>2</sup> für die bei R<sup>1</sup> angegebenen Reste steht,

20 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit den angrenzenden C-Atomen für einen gesättigten 5-8-gliedrigen carbocyclischen Ring stehen, der gegebenenfalls durch C<sub>1-4</sub>-Alkyl substituiert ist und gegebenenfalls an den Ringgliedern, die nicht an den Thiophenring gebunden sind, eine Carbonylfunktion trägt, sowie gemeinsam mit den angrenzenden C-Atomen für einen annellierte Benzolring stehen, der gegebenenfalls durch Halogen, insbesondere Chlor, Nitro, C<sub>1-4</sub>-Alkyl substituiert ist.

25 R<sup>3</sup> für die Reste CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

30 R<sup>4</sup> und R<sup>6</sup> für Wasserstoff stehen,

35 R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1-6</sub>-Alkyl, C<sub>1-4</sub>-Alkylthio-C<sub>1-4</sub>-alkyl, Cycloalkyl mit bis zu 8 C-Atomen, C<sub>2-4</sub>-Alkenyl, Phenyl, das gegebenenfalls durch C<sub>1-4</sub>-Alkyl, C<sub>1-4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1-4</sub>-Alkoxy, Halogen, insbesondere

5      Chlor, Nitro, substituiert ist, Naphthyl, Thienyl,  
das gegebenenfalls durch CN, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, C<sub>1-4</sub>-  
Alkoxycarbonyl substituiert ist, steht,

10     R<sup>7</sup>    für Wasserstoff, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl,  
Ethyl, n-, t-Butyl, C<sub>2-4</sub>-Alkenyl, insbesondere Allyl,  
sowie für Phenyl steht,

15     R<sup>8</sup>    für Wasserstoff, C<sub>1-4</sub>-Alkyl steht,

20     R<sup>9</sup>    für Wasserstoff, C<sub>1-4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl,  
Ethyl steht,

25     R<sup>10</sup>   für C<sub>1-4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl, Phenyl steht.

30     20    Insbesondere seien Verbindungen der Formel I genannt, in  
welcher

A      für den Rest der Formel Ia steht,

35     25    R<sup>1</sup>   für Wasserstoff, C<sub>1-5</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl,  
Ethyl, Isopropyl, t-Butyl, n-Pentyl, Acetyl, Phenyl,  
Nitro steht,

30     R<sup>2</sup>   für die bei R<sup>1</sup> angeführten Reste steht,

35     35    R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam für einen an den Thiophenring ankon-  
densierten Cyclopantan-, Cyclohexan-, Cycloheptan-,  
Cyclooctan-, Cyclohexanon- oder Benzolring stehen,  
die gegebenenfalls durch C<sub>1-4</sub>-Alkyl, insbesondere

5      Methyl, Halogen, insbesondere Chlor, Nitro substituiert sein können, stehen,

10      $R^3$  für die Reste CN,  $CONR^8R^9$ ,  $COOR^7$ ,  $COR^{10}$  steht,

15      $R^4$  und  $R^6$  für Wasserstoff stehen,

20      $R^5$  für Wasserstoff,  $C_{1-6}$ -Alkyl, Cycloalkyl mit bis zu 6 C-Atomen, Phenyl, das gegebenenfalls durch Halogen, insbesondere Chlor, Nitro, Methyl, Methoxy, Trifluormethyl substituiert ist, steht,

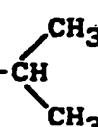
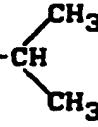
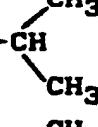
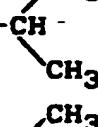
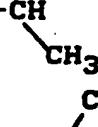
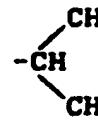
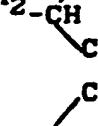
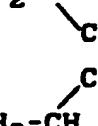
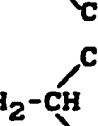
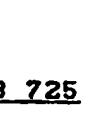
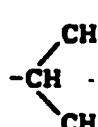
25      $R^7$  für Wasserstoff,  $C_{1-4}$ -Alkyl, insbesondere Methyl, Ethyl, n-, t-Butyl,  $C_{2-4}$ -Alkenyl insbesondere Allyl, sowie für Phenyl steht,

30      $R^8$  für Wasserstoff steht,

35      $R^9$  für Wasserstoff oder Methyl steht,

40      $R^{10}$  für Methyl oder Phenyl steht.

5 Im einzelnen seien neben den in den Beispielen genannten die folgenden Verbindungen genannt:

10	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{A} = -\text{NH}-\text{CO}-\text{NHR}^6$
15				$3-\text{CO}_2\text{Et}$
				$-\text{CH}_3$
20				$3-\text{CO}_2\text{Et}$
				
25				
				
30				$3-\text{CO}_2\text{Et}$
				
35				

reaction of 4-amino-thiophene-3- carboxylic acid ester(s) with isocyanate(s)

Patent Assignee: BASF AG (BADI )

Inventor: ACKER R D; ROSSY P A; WUERZER B

Number of Countries: 004 Number of Patents: 002

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Main IPC	Week
DE 3305866	A	19840823	DE 3305866	A	19830219		198435 B
EP 116932	A	19840829	EP 84101466	A	19840213		198435

Priority Applications (No Kind Date): DE 3305866 A 19830219

Cited Patents: DE 2040579; DE 2122636; EP 90309; US 2453564; US 3931204

Patent Details:

Patent	Kind	Lan	Pg	Filing Notes	Application	Patent
--------	------	-----	----	--------------	-------------	--------

DE 3305866 A 27

EP 116932 A G

Designated States (Regional): DE FR GB IT

Abstract (Basic): DE 3305866 A

Cpds. of formula (I) are new. In (I) R1=H, 1-10C alkyl, 2-10C alkenyl, 2-10C alkynyl, 1-10C haloalkyl, 2-10C alkoxyalkyl, 2-10C alkylthioalkyl, 3-7C cycloalkyl, phenyl(opt. substd) by or benzyl (opt. substd.); R2=1-10C alkyl, 2-10C alkenyl, 2-10C alkynyl, 8-10C phenylalkyl, 1-10C haloalkyl, 2-10C alkoxyalkyl, 2-10C alkylthioalkyl, 3-7C cycloalkyl, phenyl (opt. substd.) or benzyl (opt. substd.).

USE - As selective herbicides in a wide range of crop plants. Application may be pre- or post-emergence and is generally at a rate of 0.1-5 kg/ha or more, pref. 0.5-3 kg/ha.

0/0

Derwent Class: C02

International Patent Class (Additional): A01N-047/36; C07D-333/38

5/7/4

DIALOG(R)File 351:DERWENT WPI

(c)1997 Derwent Info Ltd. All rts. reserv.

002553909

WPI Accession No: 80-71933C EP 16371 EP A 19801001 198041

1-(1-Methyl-4-oxo-2-imidazolinyl)-3-thienyl-urea derivs. - useful as anxiolytics of low toxicity without muscle relaxing and sedating effects

Patent Assignee: HOFFMANN-LA ROCHE AG (HOFF )

Inventor: HUNKELER W; KYBURZ E

Number of Countries: 016 Number of Patents: 007

Patent Family:

Patent No	Kind	Date	Applicat No	Kind	Date	Main IPC	Week
EP 16371	A	19801001					198041 B
NO 8000720	A	19801006					198044
DK 8001087	A	19801013					198045
JP 55124770	A	19800926					198045
FI 8000559	A	19801031					198048
PT 70949	A	19810306					198113
ZA 8001347	A	19810203					198117

Priority Applications (No Kind Date): CH 80171 A 19800110; CH 792415 A 19790314

Cited Patents: DE 2448869; US 3983135; US 4025517

Patent Details:

Patent	Kind	Lan	Pg	Filing Notes	Application	Patent
--------	------	-----	----	--------------	-------------	--------

EP 16371 A G

Designated States (Regional): AT BE CH DE FR GB IT LU NL SE

Abstract (Basic): EP 16371 A

Urea derivs. of formula (I) and isocyanatothiophene derivs. of formula (II) are new: (R is 2-thienyl, 3-thienyl or 5-halo-3-thienyl; R1 is H or halogen).

20

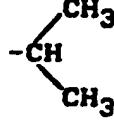
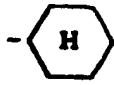
(I) are pharmaceuticals esp. useful as anxiolytics of very low toxicity. (I) have a very selective anxiolytic effect without possessing the muscle

5	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>
10	H		3-CO <sub>2</sub> Et	-
15	H		3-CO <sub>2</sub> Et	sec-Butyl
20	H		3-CO <sub>2</sub> Et	tert.-Butyl
25	-CH <sub>3</sub>	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	
30	-CH <sub>3</sub>	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	-
35	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	1-Propyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	n-Butyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	Cyclohexyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	Phenyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	4-Chlorophenyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_2\text{---}\text{CH}_3$		CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1-Propyl
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---S---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---O---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_3$		CONH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>
	$\leftarrow\text{CH}_2\text{---NH---CH}_2\text{---CH}_2\text{---CH}_3$		COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>

5

 $\text{A} = -\text{NH}-\text{CO}-\text{NR}^5\text{R}^6$ 

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^5$	$\text{R}^6$
10	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
15	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
20	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CONH}_2$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
25	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{CH}_3$	$\text{CH}_3$	
	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$	$\text{CN}$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{C}_2\text{H}_5$	

	$\text{R}^1$	$\text{R}^2$	$\text{R}^3$	$\text{R}^6$ ( $\text{R}^5 = \text{H}$ )
30	$\text{H}$	$-\text{CH}_3$	$3-\text{CO}_2\text{Et}$	
	$\text{H}$	$-\text{CH}_3$	$3-\text{CO}_2\text{Et}$	$-\text{CH}_3$
35	$\text{H}$	$-\text{CH}_3$	$3-\text{CO}_2\text{Et}$	
	$\text{H}$	$-\text{CH}_3$	$3-\text{CO}_2\text{Et}$	

5 R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>
10	H		-CH <sub>3</sub>
15	H		-
20	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub>
	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	
25	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	
	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	-
30	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	tert.-Butyl
	-Et	3-CO <sub>2</sub> Et	(R <sup>5</sup> ) (R <sup>6</sup> )
35 -Et	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>
			-CH <sub>3</sub> , -CH <sub>3</sub>

0202538

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Propyl
10	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Butyl
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopentyl
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclohexyl
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phenyl
	CH <sub>3</sub>	H	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Methoxyphenyl
15	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Propyl
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Butyl
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopentyl
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclohexyl
20	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Phenyl
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Chlorphenyl
	H	n-C <sub>5</sub> H <sub>11</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Methoxyphenyl
	H	Phenyl	3-COOOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopropyl

25 O-R<sup>5</sup>  
|  
A = -NH-C=NR<sup>6</sup>

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>
30					
	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	-Et	-CH <sub>3</sub>
35	-H	- 	3-CO <sub>2</sub> Et	-Et	-CH <sub>3</sub>
	-H	-H	3-CO <sub>2</sub> Et	-Me	- 

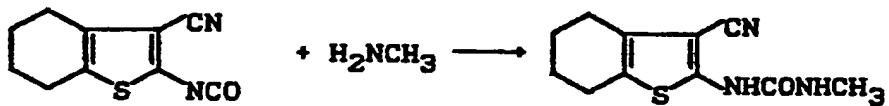
Le A 23 725

5 Die Thienylharnstoffe der Formel I sind teilweise bekannt. Sie lassen sich analog zu bekannten Verfahren herstellen (DE-OS 2 122 636, 2 627 935).

10 Die Thienylverbindungen der Formel II, in welcher der Rest A für den Harnstoffrest der Formel Ia in 2-Stellung des Thienylrings steht, lassen sich besonders vorteilhaft herstellen, indem man Thienyl-2-isocyanat der Formel III mit den Aminen der Formel IV umsetzt (vgl. Verfahren 2 oben).

15 Verwendet man 2-Isocyanato-3-cyano-4,5-tetramethylen-thiophen und Methylamin, lässt sich der Reaktionsverlauf durch folgendes Reaktionsschema darstellen:

20



25

Als Verbindungen der Formel III werden bevorzugt diejenigen eingesetzt, die in den Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> die bei den Verbindungen der Formel I genannten bevorzugten Bedeutungen besitzen. Die Verbindungen der Formel III sind 30 neu. Ihre Herstellung erfolgt nach dem unter 4 angegebenen Verfahren, das weiter unten näher erläutert wird.

Im einzelnen seien neben den in den Beispielen genannten die folgenden Verbindungen der Formel III genannt:

35

5 2-Isocyanat -3-cyano-thiophen  
2-Isocyanato-3-carbethoxy-5-isobutyl-thiophen  
2-Isocyanato-3-cyano-4,5-trimethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-methoxycarbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-ethoxycarbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
10 2-Isocyanato-3-t-butoxycarbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-cyano-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-methoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-ethoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Isocyanato-3-t-butoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
15 2-Isocyanato-3-carbethoxy-5-phenyl-thiophen  
2-Isocyanato-3-carbethoxy-4-methyl-5-phenyl-thiophen

Als Verbindungen der Formel IV werden bevorzugt diejenigen eingesetzt, die in den Substituenten R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die bei 20 den Verbindungen der Formel I genannten bevorzugten Bedeutungen haben. Die Verbindungen der Formel IV sind bekannte Verbindungen der organischen Chemie.

25 Im einzelnen seien folgende Verbindungen der Formel IV genannt:  
Ammoniak, Methylamin, Dimethylamin, Ethylamin, Diethylamin, n-Propylamin, Di-n-propylamin, Isopropylamin, Di-isopropylamin, n-Butylamin, i-Butylamin, sec-Butylamin, t-Butylamin, Cyclopentylamin, Cyclohexylamin, Anilin, 30 2-Chloranilin, 3-Chloranilin, 4-Chloranilin, 2-Nitroanilin, 3- Nitroanilin, 4-Nitroanilin, 2-Methylanilin, 3-Methylanilin, 4-Methylanilin, 2-Methoxyanilin, 3-Methoxyanilin, 4-Methoxyanilin, 2-Trifluormethylanilin, 35 3-Trifluormethylanilin, 4-Trifluormethylanilin.

5 Zur Herstellung der Thiophanharnstoffe Form I II werden die Thienylisocyanate der Formel III und die Amine der Formel IV in etwa äquimolaren Mengen umgesetzt. Ein Überschuß der einen oder der anderen Komponente bringt keine wesentlichen Vorteile.

10

Die Umsetzung kann mit oder ohne Verdünnungsmittel erfolgen. Als Verdünnungsmittel seien genannt:

15 Alle inerten organischen Lösungsmittel. Hierzu gehören insbesondere aliphatische und aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Benzin, Ligroin, Benzol, Toluol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und  $\alpha$ -Dichlorbenzol,  
20 ferner Ether wie Diethyl- und Dibutylether, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, weiterhin Ketone, wie Aceton, Methylethyl-, Methylisopropyl- und Methylisobutylketon, außerdem Ester, wie Essigsäure-methylester und -ethylester, ferner Nitrite, wie z.B. Acetonitril und Propionitril, Benzonitril, Glutarsäuredinitril, darüber hinaus Amide, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylacetamid und N-Methylpyrrolidon, sowie Dimethylsulfoxid, Tetramethylensulfon und Hexamethylphosphorsäuretriamid.

25

30 Zur Beschleunigung des Reaktionsverlaufs können Katalysatoren zugesetzt werden. Als solche sind geeignet: z.B. tertiäre Amine wie Pyridin, 4-Dimethylaminopyridin, Triethylamin, Triethylendiamin, Trimethylen-tetrahydro-  
35 pyridimidin; ferner Zinn-II- und Zinn-IV-Verbindungen

5

wie Zinn-II-octoat oder Zinn-IV- chlorid. - Die als Reaktionsbeschleuniger genannten tertiären Amine, z.B. Pyridin, können auch als Lösungsmittel verwendet werden.

10 Die Reaktionstemperaturen können in einem größeren Temperaturbereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen 0°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 20° und 70°C.

15 Normalerweise arbeitet man unter Normalsdruck, jedoch kann es zweckmäßig sein, z.B. beim Einsatz niedrig siedender Amine, in geschlossenen Gefäßen unter Druck zu arbeiten.

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens  
20 setzt man die Ausgangsstoffe im allgemeinen in stöchiometrischen Verhältnissen ein, günstig ist jedoch ein geringer Überschuß des Amins. Die Katalysatoren werden vorzugsweise in Mengen von 0,01 bis 0,1 Mol pro Mol der Reaktionskomponenten angewandt, jedoch sind auch größere  
25 Mengen, z.B. der tertiären Amine, anwendbar.

Die Reaktionsprodukte werden isoliert, indem man aus den entsprechenden Lösungsmitteln direkt ausfallende Produkte filtriert oder indem man das Lösungsmittel abdestilliert.  
30

Wie bereits erwähnt sind die Thienylisocyanate der Formel III neu. Bevorzugt sind Thienylisocyanate der Formel III, die in den Substituenten R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup>, die bei den Verbindungen der Formel I für die Substituenten R<sup>1</sup>-R<sup>3</sup> angegebenen be-  
35

5 v r zugten Bedeutung n haben. Bev r zugt Verbindungen der Formel III sind im einzelnen die im Verfahren 2 angegebenen Verbindungen.

Thienylisocyanate der Formel III lassen sich durch Umsetzung der entsprechenden Thienylamine der Formel V mit Phosgen herstellen. Verwendet man 2-Amino-3-acetyl-4,5-tetramethylenthienophen und Phosgen, lässt sich der Reaktionsablauf durch folgendes Reaktionsschema darstellen:

15



Als Thienylamine der Formel V werden bevorzugt diejenigen eingesetzt, die in den Substituenten  $R^1-R^3$  die bei den Verbindungen der Formel I angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben. Die Verbindungen der Formel V sind bekannt oder lassen sich analog zu bekannten Verfahren herstellen (K. Gewald et al. Chem. Ber. 98 (1965), S. 3571, Chem. Ber. 99 (1966), S. 94, EP-OS 4 931).

Im einzelnen seien folgende Verbindungen der Formel V genannt:

2-Amino-3-cyano-4,5-trimethylen-thiophen  
 30 2-Amino-3-methoxycarbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
 2-Amino-3-ethoxycarbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
 2-Amino-3-t-butoxy-carbonyl-4,5-trimethylen-thiophen  
 2-Amino-3-cyano-4,5-tetramethylen-thiophen  
 2-Amino-3-methoxycarbonyl-4,5-tetramethylen-thiophen

35

5 2-Amino-3-ethoxycarbonyl-4,5-tetramethylen-thiophen  
2-Amino-3-t-butoxycarbonyl-4,5-tetramethylen-thiophen  
2-Amino-3-cyano-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Amino-3-methoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Amino-3-ethoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
10 2-Amino-3-t-butoxycarbonyl-4,5-pentamethylen-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-4-methyl-5-phenyl-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-4-methyl-5-ethyl-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-5-n-butyl-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-5-isobutyl-thiophen  
15 2-Amino-3-carbethoxy-4-ethyl-5-methyl-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-5-phenyl-thiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-5-ethylthiophen  
2-Amino-3-carbethoxy-5-isopropylthiophen

20 20 Die Umsetzung der Amine der Formel V mit Phosgen kann mit oder ohne Verdünnungsmittel erfolgen.

Als Verdünnungsmittel seien genannt: inerte organische Lösungsmittel, insbesondere aliphatische und aromatische, 25 gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Benzin, Ligroin, Benzol, Toluol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol, o-Dichlorbenzol.

30 Die Umsetzung erfolgt bei -20 bis +180°C, bevorzugt bei -10 bis +100°C. Es kann bei Normaldruck oder bei erhöhtem Druck gearbeitet werden.

35

<sup>5</sup> Die Ausgangsstoffe werden in äquimolaren Mengen eingesetzt, bevorzugt ist ein Überschuß an Phosgen von 2-3 Mol pro Mol Amin der Formel V.

<sup>10</sup> Die Reaktion wird ohne oder in Gegenwart von Säurebindemitteln durchgeführt. Säurebindemittel sind bevorzugt z.B. tertiäre Amine wie Pyridin, Dimethylanilin.

<sup>15</sup> Die Amine der Formel V werden zu einer Lösung von Phosgen zugegeben und gegebenenfalls unter weiterem Einleiten von Phosgen umgesetzt. Die Umsetzung kann auch ohne Lösungsmittel durchgeführt werden.

<sup>20</sup> Wie bereits erwähnt, sind die Thienylharnstoffe der Formel VI neu.

<sup>25</sup> Bevorzugt sind Thienylharnstoffe der Formel VI, in der die Reste R<sup>3</sup> und A die bei den Verbindungen der Formel I angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben. Im einzelnen seien die weiter vorne aufgeführten Thienylharnstoffe genannt.

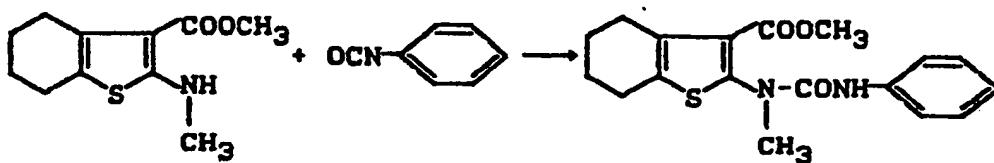
<sup>30</sup> Thienylharnstoffe der Formel VI, in welcher A für den Rest Ia steht und R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht, lassen sich nach dem weiter oben beschriebenen Verfahren aus den entsprechenden Thienylisocyanaten und den entsprechenden Aminen herstellen. Einzelheiten dieses Verfahrens sind bereits weiter oben angegeben.

<sup>35</sup> Thienylharnstoffe der Formel VI, in welcher A für den Rest Ia steht und R<sup>5</sup> für Wasserstoff steht, lassen sich aus den

5 entsprechenden Thienylaminen der Formel VII durch Umsetzung mit Isocyanaten der Formel VIII herstellen. Verwendet man 2-Methylamino-3-methoxycarbonyl-4,5-trimethylthiophen und Phenylisocyanat, lässt sich der Reaktionsablauf durch das folgende Reaktionsschema wiedergeben:

10

15



Die als Ausgangsprodukte zu verwendenden Thienylamine der Formel VII sind bekannt oder lassen sich analog zu bekannten Verfahren herstellen (K. Gewald Chem. Ber. 98 (1965), S. 3571, Chem. Ber. 99 (1966), S. 94, EP-OS 4 931, G. Coppola et.al. J. Heterocycl. Chem. 1982, S. 717).

Es werden bevorzugt die Thienylamine der Formel VII eingesetzt, die in den Substituenten R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die bei den Verbindungen der Formel I angegebenen bevorzugten Bedeutungen haben.

Im einzelnen seien die auf Seite 28 und 29 aufgeführten Verbindungen der Formel VII genannt.

35

Le A 23 725

5 Die als Ausgangsprodukt zu verwendenden Isocyanate sind bekannt. Als Beispiele seien im einzelnen genannt: Methyl-  
isocyanat, Ethyl-, n-Propyl-, Isopropyl-, n-Butyl-, Iso-  
butyl-, tert.-Butyl- und Phenylisocyanat, 3-Chlorphenyl-  
isocyanat, 4-Chlorphenylisocyanat, 2,6-Dichlorphenyliso-  
10 cyanat.

Die erfundungsgemäße Umsetzung zwischen den Thienylaminen und den Isocyanaten führt man vorzugsweise in Gegenwart eines Verdünnungsmittels durch. Als solche eignen sich  
15 alle inerten organischen Lösungsmittel. Hierzu gehören insbesondere aliphatische und aromatische, gegebenenfalls halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Benzin, Ligroin, Benzol, Toluol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform,  
20 Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und o-Dichlorbenzol, ferner Ether wie Diethyl- und Dibutylether, Glykoldimethylether und Diglykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, weiterhin Ketone, wie Aceton, Methylethyl-, Methylisopropyl- und Methylisobutylketon, außerdem Ester,  
25 wie Essigsäure-methylester und -ethylester, ferner Nitrite, wie z.B. Acetonitril und Propionitril, Benzonitril, Glutarsäuredinitril, darüber hinaus Amide, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylacetamid und N-Methylpyrrolidon, sowie Dimethylsulfoxid, Tetramethylensulfon und Hexamethylenphosphorsäuretriamid.  
30

Zur Beschleunigung des Reaktionsverlaufs können Katalysatoren zugesetzt werden. Als solche sind geeignet: z.B. tertiäre Amine wie Pyridin, 4-Dimethylaminopyridin,  
35

5 Tri thylamin, Triethylendiamin, Trimethylen-tetrahydro-pyrimidin; ferner Zinn-II- und Zinn-IV-Verbindungen wie Zinn-II-octoat oder Zinn-IV- chlorid. - Die als Reaktionsbeschleuniger genannten tertiären Amine, z.B. Pyridin, können auch als Lösungsmittel verwendet werden.

10

Die Reaktionstemperaturen können in einem größeren Temperaturbereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man zwischen 0°C und 120°C, vorzugsweise zwischen 20° und 70°C.

15

Normalerweise arbeitet man unter Normaldruck, jedoch kann es zweckmäßig sein, z.B. beim Einsatz niedrig siedender Isocyanate, in geschlossenen Gefäßen unter Druck zu arbeiten.

20

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens setzt man die Ausgangsstoffe im allgemeinen in stöchiometrischen Verhältnissen ein, günstig ist jedoch ein geringer Überschuß des Isocyanats. Die Katalysatoren werden vorzugsweise in Mengen von 0,01 bis 0,1 Mol pro Mol der Reaktionskomponenten angewandt, jedoch sind auch größere Mengen, z.B. der tertiären Amine, anwendbar.

30

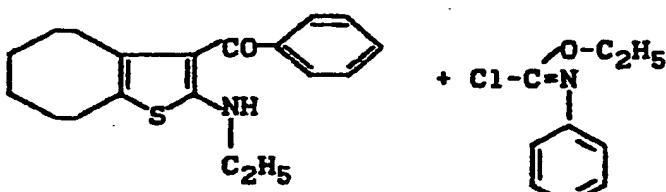
Die Reaktionsprodukte werden isoliert, indem man aus den entsprechenden Lösungsmitteln direkt ausfallende Produkte filtriert oder indem man das Lösungsmittel abdestilliert.

35

Thienylisocharnstoffe der Formel VI, in welcher A für den Rest Ib steht, lassen sich aus den entsprechenden Thienylaminen der Formel VII durch Umsetzung mit den entsprechenden Imidokohlensäureesterhalogeniden der Formel X her-

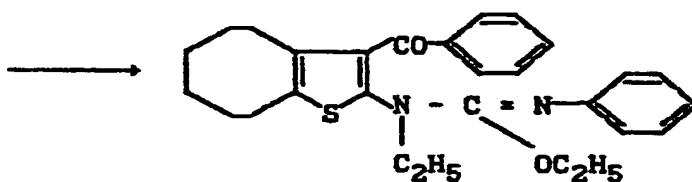
5 stellen. Verwendet man 2-Ethylamino-3-benzoyl-4,5-hexamethylenthiophen und N-Phenyl-imidokohlensäureethylesterchlorid, lässt sich der Reaktionsablauf durch das folgende Reaktionsschema wiedergeben:

10



15

20



Es werden bevorzugt die weiter oben als bevorzugt angegebenen Thienylamine eingesetzt.

25 Imidokohlensäureesterhalogenide sind bekannt.

In Formel X haben R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> bevorzugt die weiter oben angegebenen bevorzugten Bedeutungen.

30 Halogen steht insbesondere für Chlor.

Im einzelnen seien folgende Imidokohlensäureesterhalogenide genannt: N-Methylimidokohlensäureethylesterchlorid, N-Ethyl-imidokohlensäureethylesterchlorid, N-Propyl-imidokohlensäureesterchlorid, N-Phenylimidokohlensäureethylesterchlorid.

5 Die Umsetzung erfolgt gegebenenfalls in Gegenwart von Säureakzeptoren, Katalysatoren und Verdünnungsmitteln.

Die Verbindungen der Formel VII und X werden bevorzugt äquimolar eingesetzt. Ein Überschuß der einen oder anderen 10 Komponente bringt keinen wesentlichen Vorteil.

Als Verdünnungsmittel kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Frage. Hierzu gehören insbesondere aliphatische und aromatische, gegebenenfalls halogenierte 15 Kohlenwasserstoffe, wie Pentan, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Petrolether, Benzin, Ligroin, Benzol, Toluol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Chlorbenzol und  $\alpha$ -Dichlorbenzol, ferner Ether wie Diethyl- und Dibutylether, Glykoldimethylether und Di- 20 glykoldimethylether, Tetrahydrofuran und Dioxan, weiterhin Ketone, wie Aceton, Methylethyl-, Methylisopropyl- und Methylisobutylketon, außerdem Ester, wie Essigsäure-methylester und -ethylester, ferner Nitrile, wie z.B. Acetonitril und Propionitril, Benzonitril, Glutarsäuredinitril, 25 darüber hinaus Amide, wie z.B. Dimethylformamid, Dimethylacetamid und N-Methylpyrrolidon, sowie Dimethylsulfoxid, Tetramethylensulfon und Hexamethylphosphorsäuretriamid.

30 Als Säureakzeptoren können alle üblichen Säurebindemittel verwendet werden. Hierzu gehören vorzugsweise Alkalicarbonate, -hydroxide oder -alkoholate, wie Natrium- oder Kaliumcarbonat, Natrium- und Kaliumhydroxid, Natrium- und Kaliummethylat bzw. -ethylat, ferner aliphatische, aromatische oder heterocyclische Amine, beispielsweise Trime- 35

5 thylamin, Triethylamin, Tributylamin, Dimethylanilin,  
Dimethylbenzylamin, Pyridin und 4-Dimethylaminopyridin.

Als Katalysatoren können Verbindungen verwendet werden,  
welche gewöhnlich bei Reaktionen in Zweiphasensystemen aus  
10 Wasser und mit Wasser nicht mischbaren organischen Lö-  
sungsmitteln zum Phasentransfer von Reaktanden dienen  
(Phasentransferkatalysatoren). Als solche sind vor allem  
Tetraalkyl- und Trialkylaralkyl-ammoniumsalze mit vor-  
zugsweise 1 bis 10, insbesondere 1 bis 8 Kohlenstoffen je  
15 Alkylgruppe, vorzugsweise Phenyl als Arylbestandteil der  
Aralkylgruppe und vorzugsweise 1 bis 4, insbesondere 1  
oder 2 Kohlenstoffatomen im Alkylteil der Aralkylgruppen  
bevorzugt. Hierbei kommen vor allem die Halogenide, wie  
Chloride, Bromide und Iodide, vorzugsweise die Chloride  
20 und Bromide in Frage. Beispielhaft seien Tetrabutylammo-  
niumbromid, Benzyl-triethylammoniumchlorid und Methyltri-  
octylammoniumchlorid genannt.

Die Reaktionstemperatur wird zwischen etwa 0°C und 130°C,  
25 vorzugsweise zwischen etwa 20°C und 60°C gehalten. Das  
Verfahren wird vorzugsweise bei Normaldruck durchgeführt.  
Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise.

Die Wirkstoffe werden als Leistungsförderer bei Tieren zur  
30 Förderung und Beschleunigung des Wachstums, der Milch- und  
Wollproduktion, sowie zur Verbesserung der Futterverwer-  
tung, der Fleischqualität und zur Verschiebung des

5 Fleisch-Fett-Verhältnisses zugunsten von Fleisch eingesetzt. Die Wirkstoffe werden bei Nutz-, Zucht-, Zier- und Hobbytieren verwendet.

Zu den Nutz- und Zuchttieren zählen Säugetiere wie z.B.

10 Rinder, Schweine, Pferde, Schafe, Ziegen, Kaninchen, Hasen, Damwild, Pelztiere wie Nerze, Chinchilla, Geflügel wie z.B. Hühner, Puten, Gänse, Enten, Tauben, Fische wie z.B. Karpfen, Forellen, Lachse, Aale, Schleien, Hechte, Reptilien wie z.B. Schlangen und Krokodile.

15

Zu den Zier- und Hobbytieren zählen Säugetiere wie Hunde und Katzen, Vögel wie Papageien, Kanarienvögel, Fische wie Zier- und Aquarienfische z.B. Goldfische.

20 Die Wirkstoffe werden unabhängig vom Geschlecht der Tiere während allen Wachstums- und Leistungsphasen der Tiere eingesetzt. Bevorzugt werden die Wirkstoffe während der intensiven Wachstums- und Leistungsphase eingesetzt. Die intensive Wachstums- und Leistungsphase dauert je nach

25 Tierart von einem Monat bis zu 10 Jahren.

Die Menge der Wirkstoffe, die den Tieren zur Erreichung des gewünschten Effektes verabreicht wird, kann wegen der günstigen Eigenschaften der Wirkstoffe weitgehend variiert

30 werden. Sie liegt vorzugsweise bei etwa 0,001 bis 50 mg/kg insbesondere 0,01 bis 5 mg/kg Körpergewicht pro Tag. Die passende Menge des Wirkstoffs sowie die passende Dauer der Verabreichung hängen insbesondere von der Art, dem Alter, dem Geschlecht, dem Gesundheitszustand und der Art der

35 Haltung und Fütterung der Tiere ab und sind durch jeden Fachmann leicht zu ermitteln.

5 Die Wirkstoffe werden den Tieren nach den üblichen Methoden verabreicht. Die Art der Verabreichung hängt insbesondere von der Art, dem Verhalten und dem Gesundheitszustand der Tiere ab.

10 Die Wirkstoffe können einmalig verabreicht werden. Die Wirkstoffe können aber auch während der ganzen oder während eines Teils der Wachstumsphase temporär oder kontinuierlich verabreicht werden. Bei kontinuierlicher Verabreichung kann die Anwendung ein- oder mehrmals täglich 15 in regelmäßigen oder unregelmäßigen Abständen erfolgen.

Die Verabreichung erfolgt oral oder parenteral in dafür geeigneten Formulierungen oder in reiner Form. Orale Formulierungen sind Pulver, Tabletten, Granulate, Drenche, 20 Boli sowie Futtermittel, Prämixe für Futtermittel, Formulierungen zur Verabreichung über Trinkwasser.

Die oralen Formulierungen enthalten den Wirkstoff in Konzentrationen von 0,01 ppm - 100 %, bevorzugt von 0,01 ppm 25 - 1 %.

Parenterale Formulierungen sind Injektionen in Form von Lösungen, Emulsionen und Suspensionen, sowie Implantate.

30 Die Wirkstoffe können in den Formulierungen allein oder in Mischung mit anderen Wirkstoffen, Mineralsalzen, Spurenelementen, Vitaminen, Eiweißstoffen, Farbstoffen, Fetten oder Geschmacksstoffen vorliegen.

5 Die Konzentration der Wirkstoff im Futter beträgt normalerweise etwa 0,01-500 ppm, bevorzugt 0,1-50 ppm.

10 Die Wirkstoffe können als solche oder in Form von Prämixen oder Futterkonzentraten dem Futter zugesetzt werden.

15 Beispiel für die Zusammensetzung eines Kükenaufzuchtfutters, das erfindungsgemäßen Wirkstoff enthält:

200 g Weizen, 340 g Mais, 361 g Sojaschrot, 60 g Rinder-  
15 talg, 15 g Dicalciumphosphat, 10 g Calciumcarbonat, 4 g  
jodiertes Kochsalz, 7,5 g Vitamin-Mineral-Mischung und  
2,5 g Wirkstoff-Prämix ergeben nach sorgfältigem Mischen  
1 kg Futter.

25 20 In einem kg Futtermischung sind enthalten:

600 I.E. Vitamin A, 100 I.E. Vitamin D<sub>3</sub>, 10 mg Vitamin E, 1 mg Vitamin K<sub>3</sub>, 3 mg Riboflavin, 2 mg Pyridoxin, 20 mcg Vitamin B<sub>12</sub>, 5 mg Calciumpantothenat, 30 mg Nikotinsäure, 200 mg Cholinchlorid, 200 mg Mn SO<sub>4</sub> x H<sub>2</sub>O,  
25 140 mg Zn SO<sub>4</sub> x 7 H<sub>2</sub>O, 100 mg Fe SO<sub>4</sub> x 7 H<sub>2</sub>O und 20 mg Cu SO<sub>4</sub> x 5 H<sub>2</sub>O.

30 30 2,5 g Wirkstoff-Prämix enthalten z.B. 10 mg Wirkstoff, 1 g DL-Methionin, Rest Sojabohnenmehl.

35

**5 Beispiel für die Zusammensetzung eines Schweineaufzucht-futters, das erfindungsgemäßen Wirkstoff enthält:**

630 g Futtergetreideschrot (zusammengesetzt aus 200 g Mais, 150 g Gerste-, 150 g Hafer- und 130 g Weizenschrot),  
**10** 80 g Fischmehl, 60 g Sojaschrot, 60 g Tapiokamehl, 38 g Bierhefe, 50 g Vitamin-Mineral-Mischung für Schweine, 30 g Leinkuchenmehl, 30 g Maiskleberfutter, 10 g Sojaöl, 10 g Zuckerrohrmelasse und 2 g Wirkstoff-Prämix (Zusammensetzung z.B. wie beim Kükenfutter) ergeben nach sorgfältigem Mischen 1 kg Futter.

Die angegebenen Futtergemische sind zur Aufzucht und Mast von vorzugsweise Küken bzw. Schweinen abgestimmt, sie können jedoch in gleicher oder ähnlicher Zusammensetzung **20** auch zur Fütterung anderer Tiere verwendet werden.

25

30

35

6 Beispiel A

**Ratten-Fütterungsversuch**

Weibliche Laborratten 90-110 g schwer vom Typ SPF Wistar  
10 (Züchtung Hagemann) werden ad lib mit Standard Ratten-  
futter, das mit der gewünschten Menge Wirkstoff versetzt  
ist, gefüttert. Jeder Versuchsansatz wird mit Futter der  
identischen Charge durchgeführt, so daß Unterschiede in  
der Zusammensetzung des Futters die Vergleichbarkeit der  
15 Ergebnisse nicht beeinträchtigen können.

**Die Ratten erhalten Wasser ad lib.**

Jeweils 12 Ratten bilden eine Versuchsgruppe und werden  
20 mit Futter, das mit der gewünschten Menge Wirkstoff  
versetzt ist gefüttert. Eine Kontrollgruppe erhält Futter  
ohne Wirkstoff. Das durchschnittliche Körpergewicht sowie  
die Streuung in den Körpergewichten der Ratten ist in  
jeder Versuchsgruppe gleich, so daß eine Vergleichbarkeit  
25 der Versuchsgruppen untereinander gewährleistet ist.

**Während des 13-tägigen Versuchs werden Gewichtszunahme und  
Futterverbrauch bestimmt.**

30 **Es werden die aus der Tabelle ersichtlichen Ergebnisse  
erhalten:**

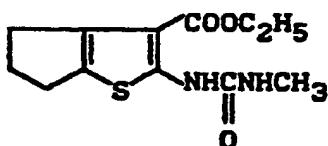
35

Le A 23 725

5 Tabelle 1 Ratten-Fütterungsversuch

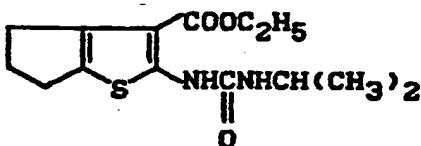
<u>Wirkstoff</u>	<u>Dosis 25 ppm</u>	<u>Gewichtszunahme</u>
Kontrolle, ohne Wirkstoff		100

10



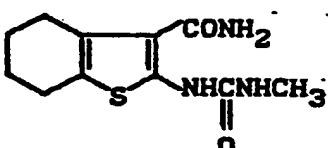
111

15



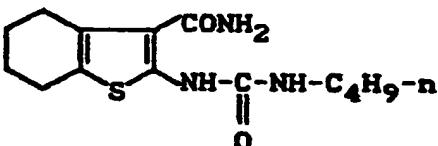
112

20



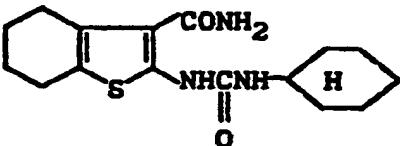
114 (10 ppm)

25



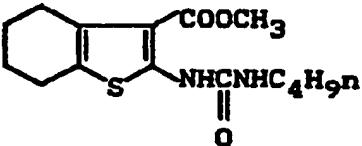
112

30



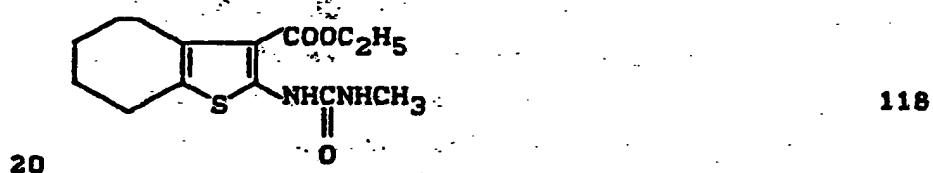
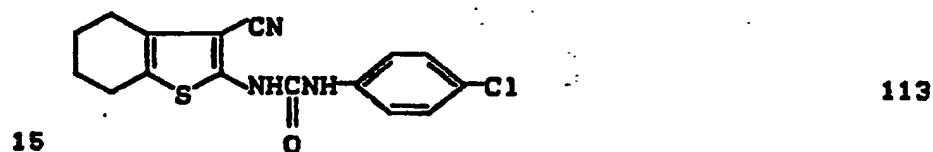
111

35



113

5 Wirkstoff      Dosis 25 ppm      Gewichtszunahme



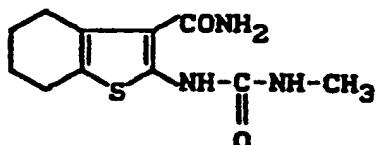
35

5 Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

Herstellung von

10



15

4,5 g (0,023 mol) 2-Amino-tetrahydrobenzothiophen-3-carbonsäureamid (hergestellt nach K. Gewald, Chem. Ber. 99, 94 (1966)) und 1,4 g (0,024 mol) Methylisocyanat wurden in 100 ml trockenem Chloroform 24 h unter Rückfluß erhitzt.

20

Dann wurde die Chloroformphase dreimal mit je 50 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft. Das anfallende Rohprodukt wurde aus Ethanol umkristallisiert.

Ausbeute: 5,5 g (95 %), Schmp. 202°C (Zers.)

25

EA Ber. C 52,2 Gef. C 52,2

H 6,0 H 5,9

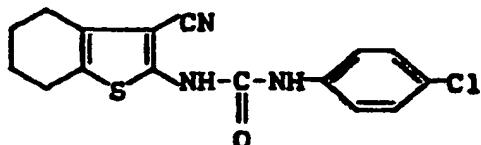
N 16,6 N 16,6

Beispiel 2

30

Herstellung von

35



5 5,3 g (0,03 mol) 2-Amino-3-cyano-tetrahydrobenzothiophen (hergestellt nach K. Gewald, Chem. Ber. 99, 94 (1966)) und 5,1 g (0,033 mol) 4-Chlorphenylisocyanat wurden in 100 ml trockenem Pyridin 10 Stunden bei 70°C gerührt. Das ausgefallene Rohprodukt wurde abgesaugt, mit verdünnter Salzsäure und mit Wasser gewaschen und aus Ethanol umkristallisiert.

10 Ausbeute: 7,1 g (72 %); Fp. > 250°C.

EA Ber. C 57,9 Gef. C 58,0

15 H 4,3 H 4,2  
N 12,7 N 12,7  
Cl 10,7 Cl 10,7

### Beispiel 3

20 N-Isopropyl-N'-2(3-cyan-4-tert.-butyl-thienyl)harnstoff

Zu einer Lösung von 2,1 g (35,6 mmol) Isopropylamin in 50 ml trockenem Toluol wurden 4 g (19,4 mmol) 2-Isocyano-4-tert.-butyl-3-cyan-thiophen, gelöst in 50 ml trockenem Toluol, zugetropft. Es wurde eine Stunde bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wurde die Lösung in 1 l 2,5 N-Salzsäure eingerührt, die organische Phase abgetrennt und mit 100 ml NaHCO<sub>3</sub>-Lösung gewaschen. Der nach Abdampfen des Toluols im Vakuum verbleibende Rückstand

25 30 wurde aus Toluol/Petrolether umkristallisiert.

Ausbeute: 1,88 g (36,5 % der Theorie),

Schmelzpunkt: 183-184°C.

5 Beispiel 4N-Isopropyl-N'-(2-carbomethoxy-thien-3-yl)harnstoff

Zu einer Lösung von 2,2 g (37 mmol) Isopropylamin in 50 ml  
10 trockenem Toluol wurde eine Lösung von 6,4 g (35 mmol)  
2-Carbomethoxy-3-isocyanato-thiophen (Esso Research and  
Engineering Company, BE 767244-Q) in 50 ml trockenem  
Toluol bei 0°C langsam zugetropft. Das Produkt fiel als  
weißer Feststoff aus. Es wurde noch 2 Stunden bei Raumtem-  
15 peratur gerührt, dann abgesaugt und im Vakuum getrocknet.  
Ausbeute: 6,8 g (80,3 % der Theorie),  
Schmelzpunkt: 119°C.

20

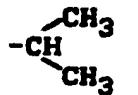
25

30

35

5 Nach den V erfahren der Beispiele 1-4 wurden folgend Verbindungen erhalten:

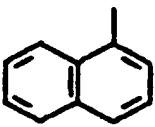
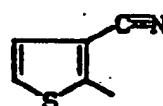
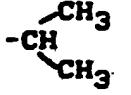
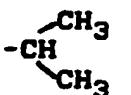


Bsp. Nr.	$R^1$	$R^2$	$R^3$	$R^6$	Fp. [C]
15	5	H	H	3-CO <sub>2</sub> Et	 158
20	6	H	H	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub> 128
	7	H	H	3-CO <sub>2</sub> Et	 136
25	8	H	H	3-CO <sub>2</sub> Et	 126
	9	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub> 128 (Z.)
30	10	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	-n-Butyl 78
	11	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	 135
35	12	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	 156

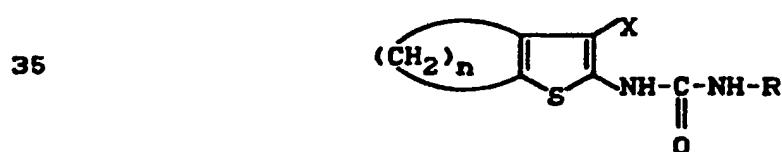
5 Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp. [C]
13	H	H	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	98
10 14		H	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub>	131
15		H	3-CO <sub>2</sub> Et		112-4
15					
16		H	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	142
17	H		3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub>	145
20					
18	H		3-CO <sub>2</sub> Et	n-Butyl	122,5
25					
19	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-C(=O)-O-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -t	-CH <sub>3</sub>	159
20	H		3-C(=O)-NH <sub>2</sub>	-CH <sub>3</sub>	> 250
30					
21	H		3-C(=O)-NH <sub>2</sub>		> 250
35					
22	H		3-C(=O)-NH <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	> 250

5 Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp. [C]	
23	H		3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	155	
10						
24	tert. Butyl	H	3-CN	H	229	
15						
25	H	i-Propyl	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	91	
26	tert. Butyl	H	3-CN		212,5	
20	27	H		3-CO <sub>2</sub> Et	H	126,5
28	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub>	121-2	
25	29	H	i-Propyl	3-CO <sub>2</sub> Et		98-99
30	30	H	H	2-CO <sub>2</sub> Me		133
30						
31	H	H	2-CO <sub>2</sub> Me	H	221	
32	H	H	2-CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>3</sub>	139	
35						

5 Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp. [C]
33	H		3-CO <sub>2</sub> Et		139-141
10					
34	-Et	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et		154
15					
35	-Et	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et		132-3
20					
36	-Et	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et		139-140
37	-Et	-CH <sub>3</sub>	3-CO <sub>2</sub> Et	n-Butyl	72
25					
38	-CH <sub>3</sub>			-CH <sub>3</sub>	222
39	-CH <sub>3</sub>				215
30	40	-CH <sub>3</sub>			221
41	-CH <sub>3</sub>			-n-Butyl	217
35					
42	-CH <sub>3</sub>				>250

5	Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp. [C]
10	43	H	H	2-CO <sub>2</sub> Me		135
	44	H	H	3-CN		225
15	45	H	H	2-CO <sub>2</sub> Me	n-Butyl	72
	46	-CH <sub>3</sub>		3-CO <sub>2</sub> Et	-CH <sub>3</sub>	135
20	47	-CH <sub>3</sub>		3-CO <sub>2</sub> Et	n-Butyl	119
	48	-CH <sub>3</sub>		3-CO <sub>2</sub> Et		113
25	49	-CH <sub>3</sub>		3-CO <sub>2</sub> Et		125
	50	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		3-COOH		174
30						

Weiter werden analog zu den Beispielen 1 - 4 Verbindungen der folgenden Formel erhalten:

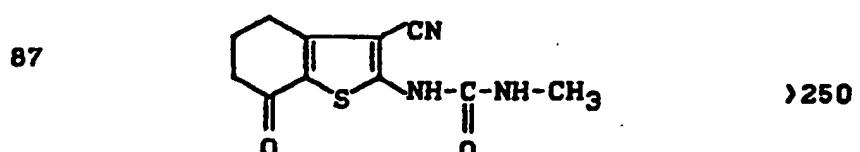
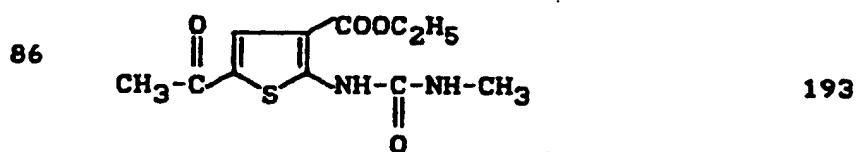
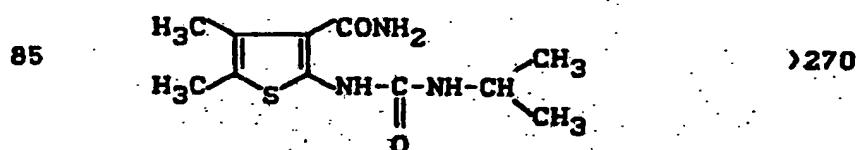
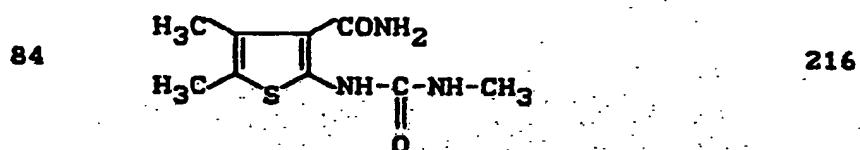


<sup>5</sup> Bsp.Nr.	n	X	R	Fp. [°C]
51	3	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	165
52	3	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Propyl	145
53	3	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlorphenyl	165
10	54	3	CN	-CH <sub>3</sub>
	55	3	CN	4-Chlorphenyl
	56	4	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	57	4	COOCH <sub>3</sub>	i-Propyl
15	58	4	COOCH <sub>3</sub>	n-Butyl
	59	4	COOCH <sub>3</sub>	Phenyl
	60	4	COOC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> t	CH <sub>3</sub>
	61	4	COOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	62	4	COOC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Phenyl
	64	4	CONH <sub>2</sub>	i-Propyl
	65	4	CONH <sub>2</sub>	n-Butyl
	66	4	CONH <sub>2</sub>	Cyclohexyl
25	67	4	CONH <sub>2</sub>	Phenyl
	68	4	CONH <sub>2</sub>	3-Chlorphenyl
	69	4	CONH <sub>2</sub>	4-Chlorphenyl
	70	4	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	71	4	CN	CH <sub>3</sub>
	72	4	CN	i-Propyl
	73	4	CN	n-Butyl
	74	4	CN	Cyclohexyl
35	75	4	CN	Phenyl
	77	4	CN	2,6-Dichlorphenyl
	78	5	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	79	5	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Propyl

<u>Bsp. Nr.</u>	<u>n</u>	<u>X</u>	<u>R</u>	<u>Fp. [°C]</u>
80	5	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Chlorphenyl	98
81	5	CN	CH <sub>3</sub>	227
82	5	CN	4-Chlorphenyl	>250
83	5	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	>230

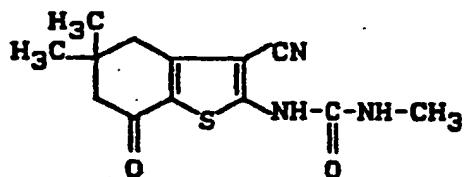
weiterhin wurden hergestellt:

<u>Bsp. Nr.</u>	<u>Formel</u>	<u>Fp. [°C]</u>
-----------------	---------------	-----------------



5 Bsp.Nr.FormelFp. [°C]

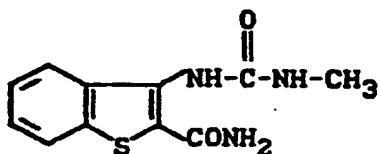
10 88



180 (Z.)

15

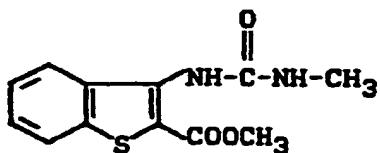
89



198

20

90



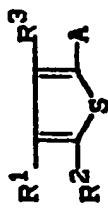
&gt;250

25

30

35

Weiterhin wurden hergestellt



A = NH - CONHR<sub>6</sub>

L A 23 725

Bsp. Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>6</sub>	Fp°C
91	H		i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	i-Butyl 113-114
92	H		i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl 121
93	H		i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl 122
94	H		Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	i-Prop 104
95	H		Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl 109
96	H		Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl 91
97	H		i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>3</sub> 94-96
98	i-Propyl		H	CONH <sub>2</sub>	i-Prop 250
99	H		Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl 97
100	H		Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	i-Butyl 146
101	Ethyl		CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Cl-Phenyl 164
102	Ethyl		CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	m-Cl-Phenyl 166
103	Ethyl		CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -Phenyl 154
104	Ethyl		CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl 182
105	Ethyl		CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-CF <sub>3</sub> -Phenyl 177

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	Fp°C
106	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	169		
107	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	131		
108	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	117		
109	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl	139		
110	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-Cl-Phenyl	97		
111	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	m-Cl-Phenyl	81		
112	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Cl-Phenyl	103		
113	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	86		
114	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl	89		
115	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-CF <sub>3</sub> -Phenyl	97		
116	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	t-Propyl	82		
117	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	81		
118	Ethyl	CH <sub>2</sub>	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	152		
119	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl	108		
120	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	106		
121	Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	61		
122	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl	81		
123	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-Cl-Phenyl	141		
124	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	m-Cl-Phenyl	155		
125	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Cl-Phenyl	166		

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	T <sup>6</sup> °C
126	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	151
127	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl	153
128	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	m-CF <sub>3</sub> -Phenyl	156
129	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	i-Propyl	112
130	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	122
131	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	140
132	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl	132
133	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	112
134	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	155
135	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl	118
136	H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	COOCH <sub>3</sub>	202
137	H		CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>3</sub>	81
138	H		CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	101
139	H		CO <sub>2</sub> Et	o-Cl-Phenyl	108
140	H		CO <sub>2</sub> Et	m-CF <sub>3</sub> -Phenyl	85
141	H		CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	147

Bsp.	Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	FP °C
142		H	Ethy1	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	106	
143		H	Ethy1	CO <sub>2</sub> Et	m-C1-Phenyl	103	
144		H	Ethy1	CO <sub>2</sub> Et	p-C1-Phenyl	108	
145		H	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>3</sub>	98	
146		Ethy1	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> -i-Propyl	t-Butyl	183	
147		Ethy1	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> -i-Propyl	i-Butyl	122	
148		Ethy1	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> -i-Propyl	i-Propyl	175	
149		Methyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> -i-Propyl	CH <sub>3</sub>	130	
150		H	H	CO <sub>2</sub> Et	o-C1-Phenyl	137	
151		H	H	CO <sub>2</sub> Et	p-C1-Phenyl	171	
152		H	H	CO <sub>2</sub> Et	m-CF <sub>3</sub> -Phenyl	147	
153		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,6-C1 <sub>2</sub> -Phenyl	189	
154		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,4-C1 <sub>2</sub> -Phenyl	219	
155		H	H	CO <sub>2</sub> Et	p-Toly1	145	
156		H	H	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	148	
157		H	H	CO <sub>2</sub> Et	p-NO <sub>2</sub> -Phenyl	240	
158		H	H	CO <sub>2</sub> Et	n-Butyl	79	
159		H	H	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	176	
160				CO <sub>2</sub> Et	pF-Phenyl	165	

Bsp.	Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp °C
161		H	H	CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	137
162		Ethyl	CH <sub>3</sub>	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>	61
163		H	H	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	114
164		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	o-C <sub>1</sub> -Phenyl	112
165		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	m-C <sub>1</sub> -Phenyl	88
166		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	p-C <sub>1</sub> -Phenyl	135
167		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	106
168		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl	108
169		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	m-CF <sub>3</sub> -Phenyl	122
170		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	144
171		H	i-Propyl	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	111
172		i-Propyl	H	CONH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	195
173		i-Propyl	H	CONH <sub>2</sub>	Phenyl	>250
174		i-Propyl	H	CONH <sub>2</sub>	Cyclohexyl	208
175		H	H	CO <sub>2</sub> Et	2,4-Dimethylphenyl	176
176		H	H	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	142
177		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,5-Dimethoxyphenyl	157
178		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Dimethylphenyl	151
179		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Methylendioxyphenyl	162

Bsp.	Nr.	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>3</sub>	R <sub>6</sub>	Fp°C
180		H	H	CO <sub>2</sub> Et	m-Tolyl	137
181		H	H	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Dimethylphenyl	109
182		H	H	CO <sub>2</sub> Et	2-0CH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	132
183		H	H	CO <sub>2</sub> Et	m-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	143
184		H	H	CO <sub>2</sub> Et	2,6-Dimethoxyphenyl	117
185		H	H	CO <sub>2</sub> Et	2,3-Dimethylphenyl	176
186		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,5-Dimethylphenyl	177
187		H	H	CO <sub>2</sub> Et	3,4-Dimethoxyphenyl	165
188		H	CH <sub>3</sub>	COOH	i-Propyl	181
189		H	CH <sub>3</sub>	COOH	o-Tolyl	232
190		H	Ethyl	CO <sub>2</sub> Et	CH <sub>3</sub>	112
191		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	i-Propyl	121
192		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	s-Butyl	92
193		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl	87
194		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	137
195		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	Cyclopentyl	113
196		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	163
197		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl	147
198		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	108

Ref.	Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp°C
199		CH <sub>3</sub>	H	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	94
200		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	i-Propyl	81
201		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	s-Butyl	81
202		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	2-Butyl	81
203		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	t-Butyl	101
204		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	Cyclohexyl	73
205		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	Phenyl	81
206		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	Cyclopentyl	74
207		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	p-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	97
208		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	o-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	81
209		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	A = NHCONCH <sub>3</sub> -Phenyl	48
210		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	o-Tolyl	80
211		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	m-Tolyl	65
212		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	p-Tolyl	93
213		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	2,3-Dimethylphenyl	99
214		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	2-i-Propylphenyl	73
215		H	n-Pentyl	CO <sub>2</sub> Et	2,4,5-Trimethylphenyl	98

Weiterhin wurden hergestellt

A =  $\text{NHCCONHR}^6$ 

Bsp. Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>6</sup>	Fp °C
216	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	160
217	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	i-Propyl	166
218	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	n-Butyl	120

5

Herstellung der AusgangsprodukteBeispiel Ia

## 10 2-Isocyanato-3-carboethoxythiophen

Zu 338 ml 20 %iger Phosgenlösung in Toluol (0,68 mol) wurde bei -10°C eine Lösung von 78 g (0,46 mol) 2-Amino-3-carboethoxythiophen in 700 ml Toluol zugetropft. Nach be-15 endetem Zutropfen ließ man innerhalb einer Stunde auf Raumtemperatur kommen und erwärmte dann langsam während einer Stunde bis zum Sieden. Die nun dunkelbraune Lösung wurde noch 2 Stunden unter Rückfluß gekocht, danach das überschüssige Phosgen durch Einleiten eines trockenen 20 Stickstoffs ausgetrieben. Anschließend wurde das Toluol im Vakuum abdestilliert mit dem Rückstand an der Ölspitze destilliert.

Siedepunkt: 95°C bei 6 Pa

Ausbeute: 61,8 g, 69 % der Theorie

## 25 Ausgangssubstanzen:

K. Gewald, Chem. Ber. 98, 3571-3577 (1965)

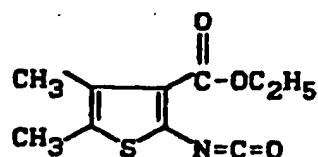
K. Gewald, E. Schinke und H. Böttcher, Chem. Ber. 99, 94-100 (1966).

## 30 Analog erhielt man die Thienylisocyanate der Formel III

Analog wurden erhalten:

35

Ib

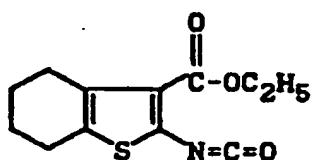


Schmp.: 38°C

Le A 23 725

5

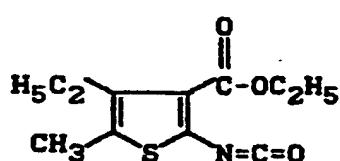
Ic



Sdp.: 120°C (1 Pa)

10

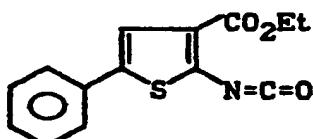
Id



Sdp.: 101°C (30 Pa)

15

Ie



Schmp.: 90-93°C

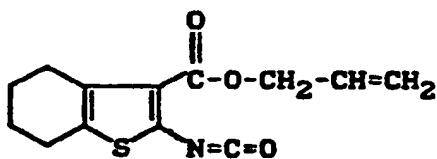
20

If



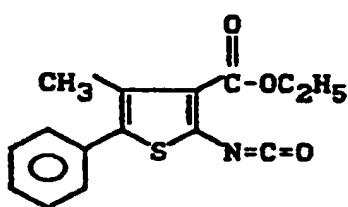
Schmp.: 62-63°C

25

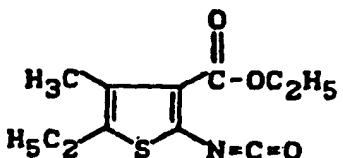
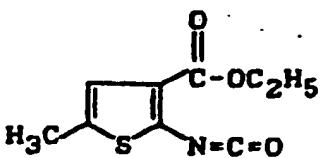
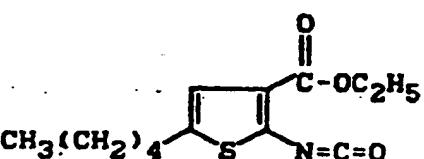
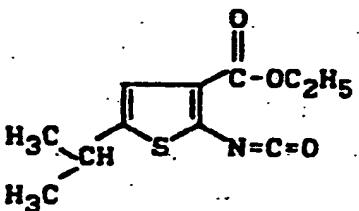
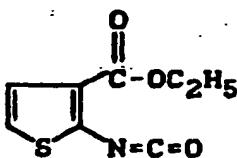
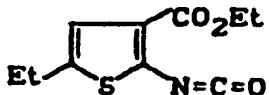
Sdp.: 160°C (30 Pa),  
IR 2200, 1690 cm<sup>-1</sup>  
im Kugelrohr destil-  
liert

30

Ih

Sdp.: 142-147°C  
(5 Pa)  
IR: 2250, 1690 cm<sup>-1</sup>

35

II		Sdp.: 103°C (30 Pa) IR: 2250, 16.0 cm <sup>-1</sup>
Ij		Sdp.: 88°C (20 Pa) IR 2250, 1700 Schmp.: 45°C
Ik		Sdp.: 125°C (90 Pa) IR 2250, 1710
Il		Sdp.: 96°C (15 Pa) IR 2250, 1710
Im		Sdp.: 75°C (40 Pa)
In		Sdp.: 105°C (20 Pa)

5 Beispiel IIIa

2-Amino-3-t-butyloxycarbonyl-4,5-dimethylthiophen

Ansatz: 100 g (0,71 mol) Cyanessigsäure tert.-  
10 butylester

51,2 g (0,71 mol) Butanon

23,9 g (0,75 mol) Schwefel

71 ml Morpholin

140 ml Ethanol p.A

15

Das Keton wurde in Ethanol gelöst, dann wurden Morpholin und Schwefel zugegeben.

20 Zu der gelben Suspension wurde Cyanessigsäure-tert.-butylester zugetropft. Anschließend wurde 3 h auf 60°C erwärmt.

Nach Abkühlung wurde das Gemisch auf 1 l Wasser gegossen, 750 ml Ether zugefügt, die organische Phase abgetrennt, die wässrige Phase mit 200 ml Ether extrahiert. Die vereinigten Extrakte wurden mit 2 x 200 ml NaOH (5 %ig),

25 200 ml Wasser, 2 x 200 ml 5 %iger  $H_2SO_4$ , 200 ml Wasser und 200 ml  $NaHCO_3$  gewaschen, mit  $Na_2SO_4$  getrocknet. Nach Verdampfen des Lösungsmittels im Vakuum verblieben 133,8 g

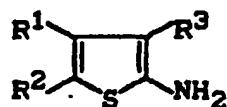
30 Impfkristalle wurden zum Rohprodukt gegeben, wobei der Kolbeninhalt erstarrte.

Ausbeute: 50 g = 31 % der Theorie

Fp: 82-85°C

35

5 Analog erhält man die Aminothiophene der Form I



10

	Bsp.Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Physik.Daten
15	IIb	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Fp 44°C
	IIc	H	i-Propyl	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	101°C (5 Pascal)
	IId	H	i-Butyl	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
	IIe	H	n-Pentyl	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	152°C (50 Pascal)
20	IIf	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	148°C (250 Pascal)

	Bsp.Nr.	R <sup>1</sup> ~~~~~ R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp. [°C]
25	IIg	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>3</sub>	COO <sub>2</sub> CH <sub>5</sub>	90
	IIh	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>3</sub>	CN	149
	III	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>4</sub>	COOCH <sub>3</sub>	112
	IIj	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>4</sub>	CN	143
	IIk	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>4</sub>	CONH <sub>2</sub>	185
	III	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>5</sub>	COOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	105
	IIl	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>5</sub>	CN	121
	IIm	↔CH <sub>2</sub> ↔ <sub>5</sub>	CONH <sub>2</sub>	170

35

Le A 23 725

5 Patentansprüche1. Verwendung von Thiarylharnstoffen oder -isocharn-  
stoffen der Formel I

10



15

in welcher

20

A für die Reste Ia und Ib steht

25



30

$\text{R}^1$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy,  
 $\text{R}^2$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy,  
 Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio,  
 Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Rest  
 aus der Gruppe Alkyl, Acyl, Aroyl, Aryl steht,

35

$\text{R}^2$  für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy,  
 Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio,  
 Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Rest  
 aus der Gruppe Acyl, Aroyl, Alkyl, Aryl steht,

5       $R^1$  und  $R^2$  gem insam mit d n angrenz nden C-At men für  
einen gegebenenfalls substituierten gesättigten  
oder ungesättigten carbocyclischen oder hetero-  
cylischen Ring stehen, der gegebenenfalls eine  
Carbonylfunktion tragen kann,

10       $R^3$  für die Reste CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

15       $R^4$  für Wasserstoff oder Alkyl steht,

20       $R^5$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

25       $R^6$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls sub-  
stituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

30       $R^7$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls  
substituiertes Aryl steht,

35       $R^8$  für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

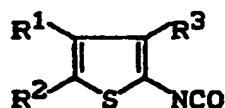
30       $R^9$  für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl  
steht,

35       $R^{10}$  für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gege-  
benenfalls substituiertes Aryl steht,

als leistungsfördernde Mittel für Tiere.

## 5 2. Thi nyliisocyanat der Formel III

10



III

in welcher

15      R<sup>1</sup>      für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Alkyl, Acyl, Aroyl, Aryl steht,

20      R<sup>2</sup>      für Wasserstoff, Halogen, Nitro, CN, Alkoxy, Alkylthio, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Alkoxyalkyl, gegebenenfalls substituierte Reste aus der Gruppe Acyl, Aroyl, Alkyl, Aryl steht,

25      R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> gemeinsam mit den angrenzenden C-Atomen für einen gegebenenfalls substituierten gesättigten oder ungesättigten carbocyclischen Ring stehen, der gegebenenfalls eine Carbonylfunktion tragen kann,

30      R<sup>3</sup>      für die Reste COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

35      R<sup>7</sup>      für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Methyl, Cycloalkyl, C<sub>2-4</sub>-Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

5 R<sup>8</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

R<sup>9</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

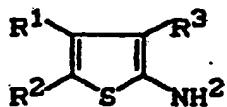
10

R<sup>10</sup> für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht mit Ausnahme von 3-Methoxycarbonyl-thien-2-yl-isocyanat.

15

3. Verfahren zur Herstellung der Thienylisocyanate der Formel III gemäß Anspruch 2, dadurch gekennzeichnet, daß man Thienylamine der Formel V

20



V.

25

in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> die in Anspruch 2 angegebene Bedeutung besitzen,

30

mit Phosgen umsetzt.

35

5 4. Thiarylharnstoffe oder -isocharnstoffe der Formel VI



VI

10 in welcher

n für 3, 4, 5 oder 6 steht,

15 A für die Reste Ia und Ib steht



Ia



Ib

25 R<sup>3</sup> für den Fall, daß n für 3, 5, 6 steht, für die Reste CN, COOR<sup>7</sup>, CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht und für den Fall, daß n für 4 steht, für die Reste COOCH<sub>3</sub>, COO(C<sub>2-4</sub>-Alkenyl), CONR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, COR<sup>10</sup> steht,

30 R<sup>4</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

35

5      R<sup>6</sup>    für Wasserstoff, gegebenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl,  
gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

10     R<sup>7</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls sub-  
stituiertes Aryl steht,

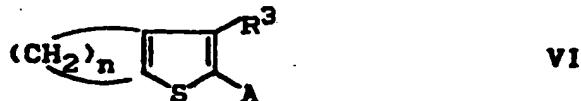
15     R<sup>8</sup>    für Wasserstoff Alkyl oder Cycloalkyl steht,

20     R<sup>9</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl  
steht,

25     R<sup>10</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gege-  
benfalls substituiertes Aryl steht.

5.    Verfahren zur Herstellung der Thienylharnstoffe oder  
-isoharnstoffe der Formel VI

25



30     in welcher

n     für 3, 4, oder 6 steht,

35

5       $\lambda$       für die Reste Ia und Ib steht



Ia

10



Ib

15       $\text{R}^3$       für den Fall, daß n für 4, 5, 6 steht, für die Reste  $\text{CN}$ ,  $\text{COOR}^7$ ,  $\text{CONR}^8\text{R}^9$ ,  $\text{COR}^{10}$  steht und für den Fall, daß n für 4 steht, für die Reste  $\text{COOCH}_3$ ,  $\text{COO}(\text{C}_{2-4}\text{-Alkenyl})$ ,  $\text{CONR}^8\text{R}^9$ ,  $\text{COR}^{10}$  steht,

20

$\text{R}^4$       für Wasserstoff oder Alkyl steht,

25

$\text{R}^5$       für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

30

$\text{R}^6$       für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl oder Heteroaryl steht,

$\text{R}^7$       für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Cycloalkyl, Alkenyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,

35

5      R<sup>8</sup>    für Wasserstoff, Alkyl oder Cycloalkyl steht,

10     R<sup>9</sup>    für Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes  
Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl  
steht,

15     R<sup>10</sup>   für gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Aryl steht,  
dadurch gekennzeichnet,  
a) daß man für den Fall, daß A für den Rest Ia steht  
und R<sup>5</sup> für Wasserstoff steht, Thienylamine der  
Formel VII .



VII

### in welcher

$n$ ,  $\mathbb{R}^3$  und  $\mathbb{R}^4$  die oben angegebene Bedeutung haben.

### mit Isocyanaten der Formel VIII

30



VIII

in welcher

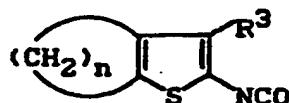
35

R<sup>6</sup> die oben angegebene Bedeutung hat,

ums tzt. od r

5        b) daß man für den Fall, daß A für den Rest Ia steht und R<sup>4</sup> für Wasserstoff steht, Thienyl-isocyanate der Formel IX

10



IX

in welcher

15

n und R<sup>3</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

mit Aminen der Formel IV

20



IV

in welcher

R<sup>5</sup> und R<sup>6</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

25

umgesetzt, oder

c) daß man für den Fall, daß A für den Rest Ib steht, Thienylamine der Formel VII

30



VII

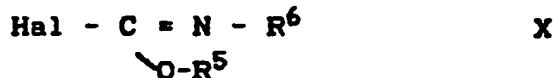
in welcher

35

n, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> die oben angegebene Bedeutung haben,

5

mit Imidokhlensäursterhalogeniden der  
Formel X



10

in welcher

$\text{R}^5$  und  $\text{R}^6$  die oben angegebene Bedeutung haben  
und

5

Hal für Halogen steht,

umsetzt.

0 6.

Mittel zur Leistungsförderung von Tieren gekenn-  
zeichnet durch einen Gehalt an Thienylharnstoffen  
oder -isoharnstoffen der Formel I gemäß Anspruch 1.

5 7.

Tierfutter, Trinkwasser für Tiere, Zusätze für Tier-  
futter und Trinkwasser für Tiere gekennzeichnet durch  
einen Gehalt an Thienylharnstoffen oder -isoharnstof-  
fen der Formel I gemäß Anspruch 1.

8.

Verwendung von Thienylharnstoffen oder -isoharnstof-  
fen der Formel I gemäß Anspruch 1 zur Leistungsför-  
derung von Tieren.

9.

Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Leistungs-  
förderung von Tieren, dadurch gekennzeichnet, daß man  
Thienylharnstoffe oder -isoharnstoffe der Formel I

5

gemäß Anspruch 1 mit Streck- und/oder Verdünnungsmitteln vermischt.

10. Verfahren zur Herstellung von Tierfutter, Trinkwasser für Tiere oder Zusätze für Tierfutter und Trinkwasser

10 für Tiere, dadurch gekennzeichnet, daß man Thienylharnstoffe oder -isoharnstoffe der Formel I gemäß Anspruch 1 mit Futtermitteln oder Trinkwasser und gegebenenfalls weiteren Hilfstoffen vermischt.

15

20

25

30

35



Europäisches  
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

0202538

Nummer der Anmeldung

EP 86 10 6209

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE

Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int. Cl. 4)
Y	DE-A-2 645 613 (AMERICAN CYANAMID) * Ansprüche * ---	1, 4-7	A 23 K 1/16 C 07 D 333/38 C 07 D 333/68 C 07 D 333/78 C 07 D 333/80
Y	US-A-3 989 505 (L.G. NICKELL) * Ansprüche * ---	1, 4, 7	
Y	DE-A-2 510 936 (CHEVRON) * Ansprüche * ---	1, 6	
A	DE-A-2 648 248 (AMERICAN CYANAMID) * Ansprüche * ---	1, 4-7	
A	AT-B- 311 994 (DR. F. SAUTER) * Ansprüche * ---	1, 4	
A	CHEMICAL ABSTRACTS, Band 91, Nr. 1, 2. Juli 1979, Seite 97, Nr. 814x, Columbus, Ohio, US; & BR - A - 78 02 533 (AMERICAN CYANAMID CO.) 19.12.1978 * Zusammenfassung * -----	1, 4-7	RECHERCHIERTE SACHGEBiete (Int. Cl. 4) A 23 K 1/00 C 07 D 333/00

Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt

Recherchenort DEN HAAG	Abschlußdatum der Recherche 25-08-1986	Prüfer CHOULY J.
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE		
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet		E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmelde datum veröffentlicht worden ist
Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen V : röffentlichung derselben Kategorie		D : in der Anmeldung angeführtes Dokument
A : technologischer Hintergrund		L : aus andern Gründen angeführtes Dokument
O : nichtschriftliche Offenbarung		
P : Zwischenliteratur		& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument
T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze		